

Rec'd PCT/KR 12 JAN 2005  
PCT/KR 03/01396  
RO/KR 23. 07. 2003

REC'D 13 AUG 2003

WIPO PCT



별첨 사본은 아래 출원의 원본과 동일함을 증명함.

This is to certify that the following application annexed hereto is a true copy from the records of the Korean Intellectual Property Office.

출원 번호 : 10-2002-0041267  
Application Number

출원 년 월 일 : 2002년 07월 15일  
Date of Application JUL 15, 2002

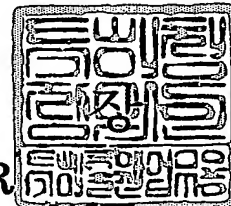
출원인 : 경동제약 주식회사  
Applicant(s) KYUNG DONG PHARM. CO., LTD.

**PRIORITY DOCUMENT**  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH  
RULE 17.1(a) OR (b)



2003 년 07 월 23 일

특 허 청  
COMMISSIONER



BEST AVAILABLE COPY

## 【서지사항】

【서류명】	특허출원서
【권리구분】	특허
【수신처】	특허청장
【제출일자】	2002.07.15
【발명의 명칭】	9-[4- 아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린 의 제조방법
【발명의 영문명칭】	A PROCESS FOR PREPARING 9-[4-ACETOXY-3-(ACETOXYMETHYL)BUT-1-YL]-2-AMINOPURINE
【출원인】	
【명칭】	경동제약 주식회사
【출원인코드】	1-1998-000085-9
【대리인】	
【성명】	이주기
【대리인코드】	9-1998-000333-0
【포괄위임등록번호】	2002-043164-1
【대리인】	
【성명】	이순노
【대리인코드】	9-2002-000227-3
【포괄위임등록번호】	2002-043165-8
【발명자】	
【성명의 국문표기】	이병석
【성명의 영문표기】	LEE,Byoung Suk
【주민등록번호】	531228-1148618
【우편번호】	137-755
【주소】	서울특별시 서초구 방배3동 1015 임광아파트 1동 1106호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	신상훈
【성명의 영문표기】	SHIN,Sang Hoon
【주민등록번호】	700120-1121219
【우편번호】	427-040
【주소】	경기도 과천시 별양동 주공아파트 308동 402호
【국적】	KR

## 【취지】

특허법 제42조의 규정에 의하여 위와 같이 출원합니다. 대  
리인  
기 (인) 대리인  
이순노 (인)

## 【수수료】

【기본출원료】 18 면 29,000 원

【가산출원료】 0 면 0 원

【우선권주장료】 0 건 0 원

【심사청구료】 0 항 0 원

【합계】 29,000 원

## 【첨부서류】

1. 요약서·명세서(도면)\_1통

## 【요약서】

## 【요약】

본 발명은 팜시클로버(Famciclovir)로 명명되며, 항바이러스 활성을 갖는 푸린유도체 약물인 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린 (9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)을 제조하는 방법에 관한 것으로서,

본 발명에 따른 방법은 2-아미노푸린(2-Aminopurine)과 2-아세톡시메틸-4-브로모부트-1-일-아세테이트(2-Acetoxymethyl-4-bromobut-1-yl-acetate)를 탈륨(I) 에톡시드 (Thallium(I) ethoxide) 하에서 반응시켜 목적 화합물인 팜시클로버를 제조하는 방법이 제공되며,

본 발명에 따른 제조방법은 온화한 반응 조건 하에 높은 위치 선택성을 갖고서 매우 높은 수율로 상기한 목적 화합물을 얻을 수가 있다.

## 【색인어】

팜시클로버, 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린

## 【명세서】

## 【발명의 명칭】

9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린의 제조방법 {A PROCESS FOR PREPARING 9-[4-ACETOXY-3-(ACETOXYMETHYL)BUT-1-YL]-2-AMINOPURINE}

## 【발명의 상세한 설명】

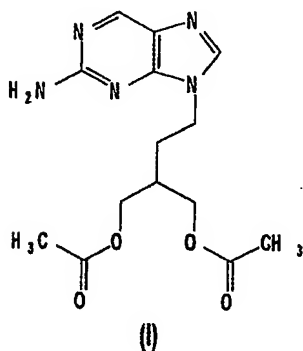
## 【발명의 목적】

## 【발명이 속하는 기술분야 및 그 분야의 종래기술】

<1> 본 발명은 항바이러스 활성을 갖는 푸린유도체의 약물인 하기 구조식(I)의 화합물, 일명 팜시클로버(Famciclovir)인 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)을 제조하는 방법에 관한 것이며,

## &lt;2&gt; [구조식 I]

&lt;3&gt;

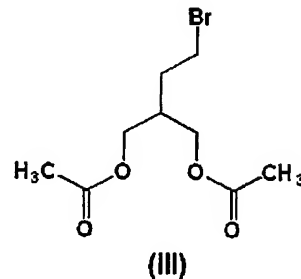
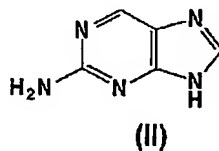
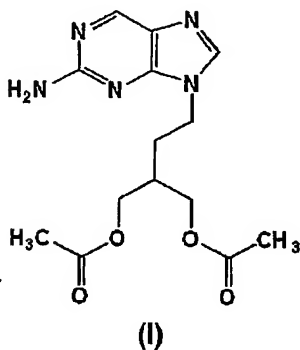


<4> 더욱 상세하게는, 항바이러스 활성을 갖는 푸린유도체의 약물인 구조식(I)의 화합물, 일명 팜시클로버(Famciclovir)인 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)을 하기 구조식(II)의

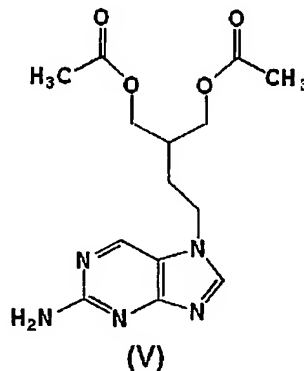
2-아미노푸린(2-Aminopurine)과 하기 구조식(III)의 2-아세톡시메틸-4-부로모부트-1-일-아세테이트(2-Acetoxymethyl-4-bromobut-1-yl-acetate)로부터 하기 구조식(IV)의 탈륨(I) 에톡시드(Thallium(I) ethoxide) 하에서 반응시킴으로써, 반응 부생성물인 하기 구조식(V)의 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(7-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)의 생성을 최소화하여 높은 선택성을 갖고서 하기 구조식(I)의 화합물을 제조하는 신규 방법에 관한 것이다.

<5> [구조식 I, II, III, IV, V]

<6>



TIOEt  
(IV)

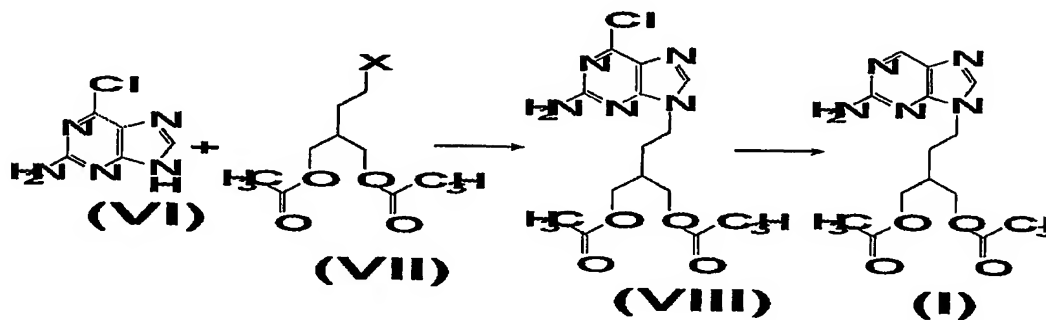


<7> 상기 구조식(I)의 화합물을 제조하는 종래 기술은 유럽특허 제182,024호, 미국특허 제5,684,153호, 미국특허 제5,138,057호 및 미국특허 제5,917,041호에 개시되어 있다.

<8> 이들 중, 유럽특허 제182,024호 및 미국특허 제5,684,153호에 따르면, 하기 반응식 1에 나타낸 바와 같이 하기 구조식(VI)의 2-아미노-6-클로로푸린 (2-Amino-6-chloropurine)과 하기 구조식(VII)의 2-아세톡시메틸-4-할로부트-1-일-아세테이트(2-Acetoxymethyl-4-halobut-1-yl-acetate)로 부터 하기 구조식(VIII)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노-6-클로로푸린 (9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-amino-6-chloropurine)을 생성시키고, 환원제인 팔라듐(Palladium)을 사용하여 하기 구조식(I)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린을 수득하는 제조방법을 제안하고 있다.

<9> [반응식 1]

<10>

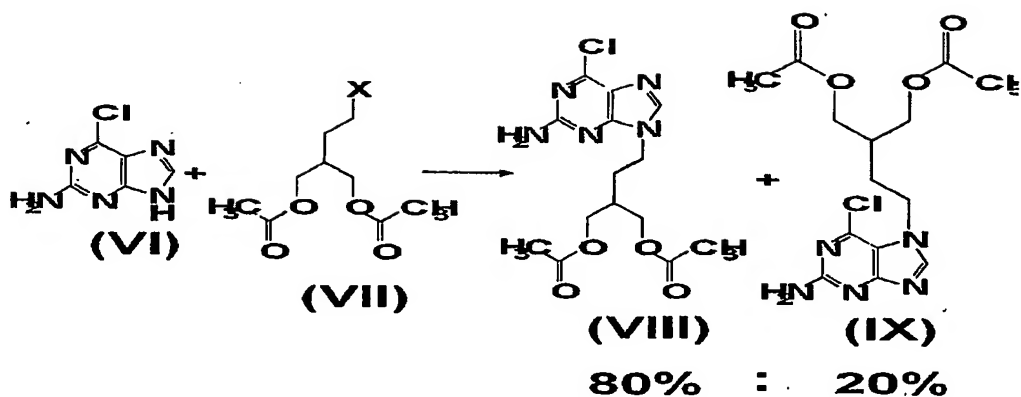


<11> 상기 식에서 X는 할로젠 원자이다.

<12> 그러나, 상기한 종래의 방법은 하기 반응식 2에 나타낸 바와 같이, 하기 구조식 (VI)의 화합물과 하기 구조식(VII)의 화합물로부터 하기 구조식(VIII)의 화합물과 반응 부생성물인 하기 구조식(IX)의 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노-6-클로로푸린(7-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-amino-6-chloropurine)이 80%:20%의 비율로 생성되어 선택성이 낮으며, 그 정제가 매우 어려운 문제점이 있다.

<13> [반응식 2]

<14>



<15> 상기 식에서 X는 할로겐 원자이다.

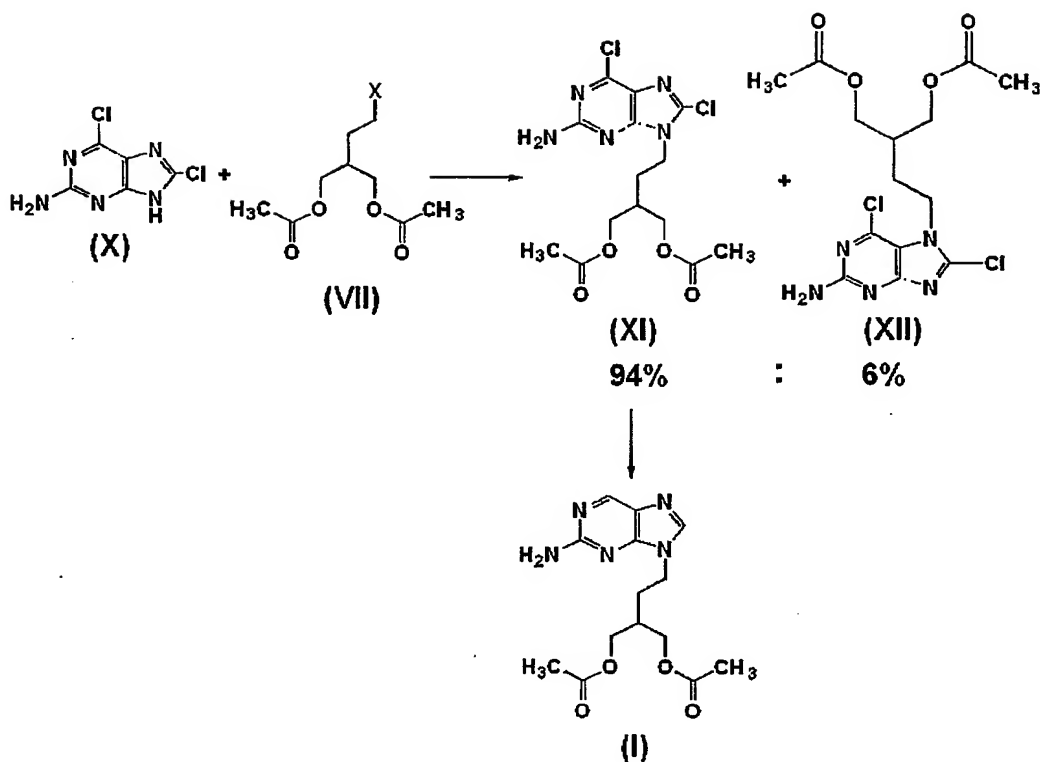
<16> 또한, 상기 반응식 1에서, 상기 구조식(VIII)의 화합물로부터 최종 목적 생성물인 상기 구조식(I)의 화합물을 제조 시 폭발성이 매우 높은 환원제인 팔라듐(Palladium)을 사용하여야만 하므로 공정상 비효율적이어서 산업적 적용에는 부적합하다는 문제점이 있다.

<17> 그리고, 미국특허 제5,138,057호는 하기 반응식 3에 나타낸 바와 같이, 하기 구조식(X)의 2-아미노-6,8-디클로로퓨린(2-Amino-6,8-dichloropurine)과 하기 구조식(VII)의 2-아세톡시메틸-4-할로부트-1-일-아세테이트(2-Acetoxymethyl-4-halobut-1-yl-acetate)로부터 하기 구조식(XI)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노-6,8-디클로로퓨린(9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-amino-6,8-dichloropurine)을 생성시키고, 환원제인 팔라듐(Palladium)을 사용하여 가압 조건 하에서 하기 구조식(I)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노퓨린을 수득하는 제조방법을 제안하고 있다.



<18> [반응식 3]

<19>



<20> 상기 식에서 X는 할로젠 원자이다.

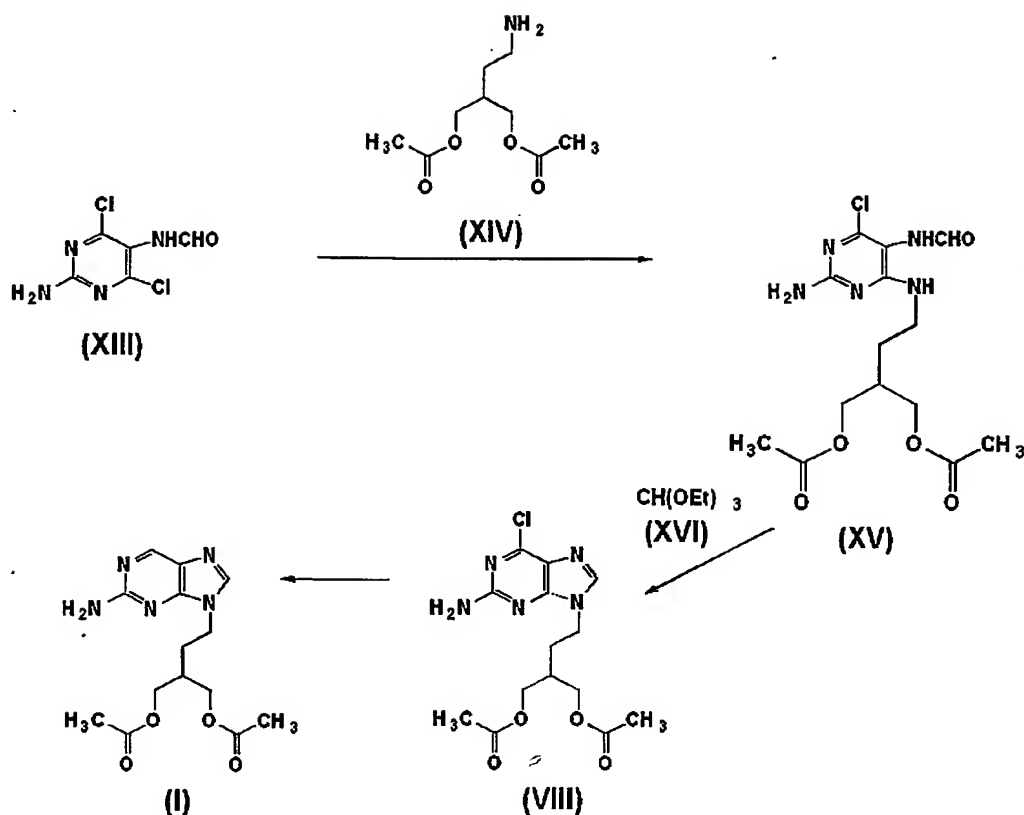
<21> 그러나, 상기한 종래의 방법은 상기 구조식(X)의 화합물과 상기 구조식(VII)의 화합물로부터 상기 구조식(XI)의 화합물과 반응 부생성물인 상기 구조식(XII)의 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노-6,8-디클로로푸린 (7-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-amino-6,8-dichloropurine)이 94% : 6%의 비율로 생성되어서 선택성은 비교적 높으나, 상기 구조식(XI)의 화합물로부터 최종 목적 생성물인 상기 구조식(I)의 화합물을 제조시 앞서 언급한 유럽특허 제182,024호 및 미국 특허 제5,684,153호에서와 마찬가지로 폭발성이 매우 높은 환원제인 팔라듐(Palladium)

을 사용하여야만 하고, 또한 그 반응이 가압 조건(50psi 이상) 하에서 수행되어야 하므로 공업적으로 적용하기가 어렵다는 문제점이 있다.

<22> 또한, 미국특허 제5,917,041호는 하기 반응식 4에 나타낸 바와 같이, 하기 구조식(XIII)의 N-(2-아미노-4,6-디클로로-5-피리미디닐)포름아미드 (N-(2-Amino-4,6-dichloro-5-pyrimidinyl)formamide)와 하기 구조식(XIV)의 2-아세톡시메틸-4-아미노부트-1-일-아세테이트(2-Acetoxymethyl-4-aminobut-1-yl-acetate)로 부터 하기 구조식(XV)의 화합물을 제조한 후, 하기 구조식(XVI)의 트리에틸올소포르메이트 (Triethylorthoformate)로부터 하기 구조식(VIII)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노-6-클로로푸린 (9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-amino-6-chloropurine)을 생성시키고, 환원제인 팔라듐(Palladium)을 사용하여 하기 구조식(I)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린을 수득하는 방법을 제안하고 있다.

<23> [반응식 4]

&lt;24&gt;

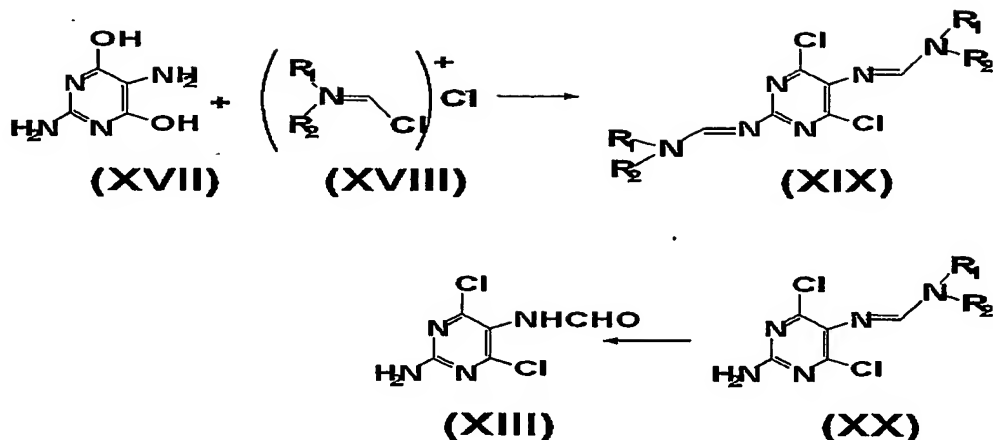


&lt;25&gt;

그러나, 상기한 종래의 방법은, 출발물질로서의 상기 구조식(XIII)의 화합물을 얻기 위하여 하기 반응식 5에 나타낸 바와 같이, 하기 구조식(XVII)의 2,5-디아미노-4,6-디히드록시피리미딘(2,5-Diamino-4,6-dihydroxypyrimidine)과 하기 구조식(XVIII)의 클로로메틸렌이미늄염(Chloromethyleniminium salt)을 사용하여야만 하나 이들 원료 화합물은 고가이며, 또한 하기 구조식(XVII)의 화합물로부터 여러 단계를 거쳐서 최종 목적 생성물인 상기 구조식(I)의 화합물을 제조시 그 수율이 약 32%로서 매우 낮고, 앞서 종래의 기술로서 언급한 유럽특허 제182,024호 및 미국특허 제5,684,153호와 마찬가지로 폭발성이 매우 높은 환원제인 팔라듐(Palladium)을 사용하여야만 하므로 반응경로가 길고 공정상 비효율적이어서 공업적으로 적용하기 어렵다는 문제점이 있다.

<26> [반응식 5]

<27>



【발명이 이루고자 하는 기술적 과제】

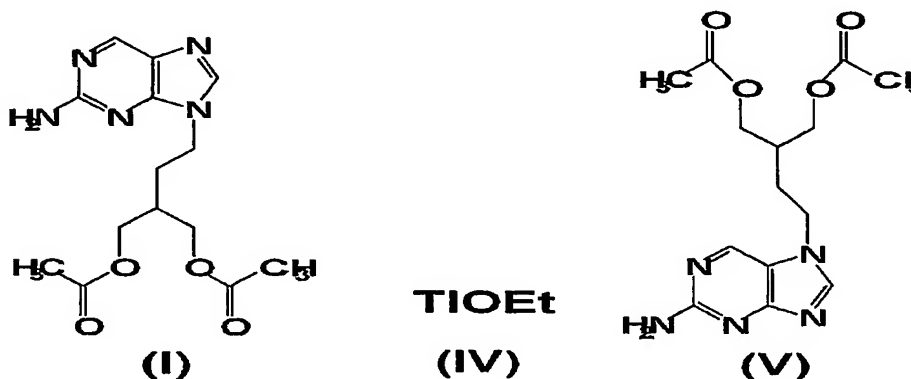
<28> 따라서, 항바이러스 활성을 갖는 푸린유도체 약물인 팜시클로버(Famciclovir), 즉 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린 (9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)을 제조함에 있어서, 반응 부 생성물인 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린 (7-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)의 생성을 최소화함으로써 상기한 팜시클로버를 높은 선택성으로 온화한 반응 조건 하에 제조할 수 있는 제법의 개발이 당업계에 요망되어 왔다.

【발명의 구성 및 작용】

<29> 본 발명에 따른 제조방법에 의하면, 항바이러스 활성을 갖는 푸린유도체, 일명 팜시클로버(Famciclovir)인 하기 구조식(I)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린 (9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)은 이 반응의 핵심물질인 하

기 구조식(IV)의 탈륨(I) 에톡시드(Thallium(I) ethoxide)를 도입함으로써 반응 부생성물인 하기 구조식(V)의 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(7-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)의 생성을 최소화하여 매우 높은 선택성(98%)으로 순수하게 제조할 수가 있다.

&lt;30&gt;



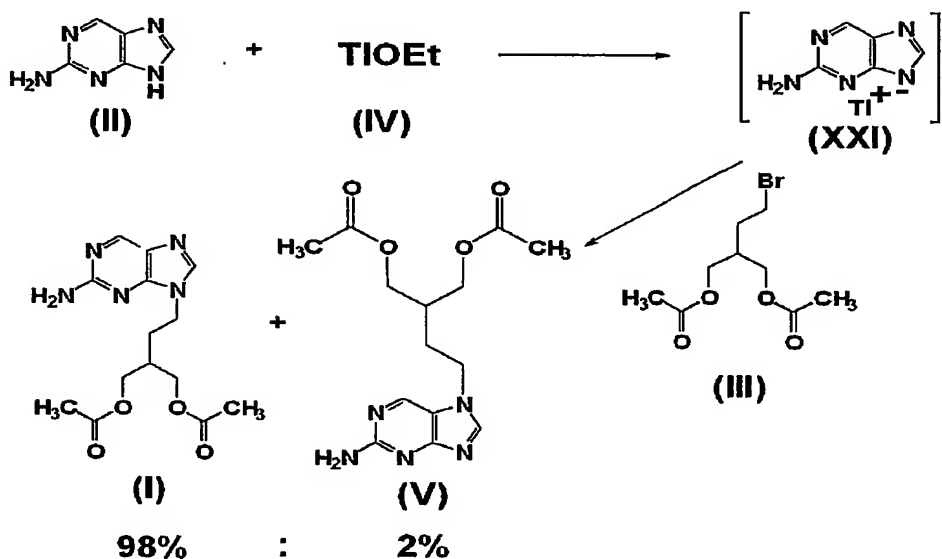
&lt;31&gt;

보다 구체적으로는, 하기 반응식 6에 나타난 바와 같이, 본 발명의 방법은 하기 구조식(II)의 2-아미노푸린(2-Aminopurine)과 하기 구조식(IV)의 탈륨(I) 에톡시드(Thallium(I) ethoxide)를 극성 유기용매 중에서 약 0℃ 내지 100℃, 바람직하게는 약 10℃ 내지 30℃의 온도범위에서 약 2시간 내지 50시간, 바람직하게는 약 20시간 내지 40시간동안 반응시키는 것에 의하여 중간체인 하기 구조식(XXI)의 2-아미노푸린·탈륨염(2-Aminopurine·Thallium salt)을 얻고, 이를 하기 구조식(III)의 2-아세톡시메틸-4-브로모부트-1-일-아세테이트(2-Acetoxymethyl-4-bromobut-1-yl-acetate)와 극성 유기용매 중에서 약 0℃ 내지 100℃, 바람직하게는 약 10℃ 내지 30℃의 온도범위에서, 약 50시간 내지 200시간, 바람직하게는 약 70시간 내지 100시간 동안 반응시키는 것에 의하여, 최종 목적화합물인 하기 구조식(I)의 팜시클로버(Famciclovir)를 제조할 수 있으며, 또한

하기 구조식(I)의 팜시클로버(Famciclovir)와 반응 부생성물인 하기 구조식(V)의 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린이 98%:2%의 우수한 비율로 위치 선택적으로 생성되므로 목적 화합물을 매우 순수하게 제조할 수 있다.

<32> [반응식 6]

<33>



<34> 출발물질로 사용되는 상기 구조식(II)의 화합물은 상업적으로 구입하거나 직접 제조하여 사용할 수 있고, 그 제조방법 등은 Heterocycles, 17, 405 (1982) 및 Journal of the Chemistry Society, 2060 (1954)에 상세히 기재되어 있으며, 또한 출발물질로 사용되는 결가지 탄화수소인 상기 구조식(III)의 화합물도 공지된 방법으로 직접 제조하여 사용할 수 있고, 그 제조방법 등은 유럽특허공고 제141,927호에 상세히 기재되어 있다.

<35> 본 발명의 제조방법에 있어서 사용될 수 있는 극성 유기용매로서 바람직한 예는 N,N-디메틸포름아미드, 디페닐술폭시드 및 메탄올, 에탄올, 이소프로판올 등의 탄소수 1

~3의 저급 알콜성 용매 중에서 선택되는 임의의 용매, 또는 이들의 임의의 혼합물을 들 수 있다.

<36> 다음의 실시예는 본 발명을 실증적으로 예증하기 위한 것으로서 본 발명의 범위를 제한하는 것은 아니다.

<37> [실시예 1] 2-아미노푸린·탈륨염의 제조

<38> 6.75g(50mmole)의 2-아미노푸린을 140ml의 무수 에탄올에 혼탁시키고 반응기의 온도를 15℃ 이하로 유지시켰다. 이 반응 혼합액에 18.72g(75 mmole)의 탈륨(I) 에톡시드를 서서히 가한 후 상온에서 36시간 동안 교반하였다. 반응 완결 후, 냉각하여 여과하고, 무수 에탄올로 세척한 후, 15.57g (92%)의 2-아미노푸린·탈륨염을 얻었다.

<39> 융점 : 290~292℃ (Dec.)

<40> IR :  $V_{\max}(\text{cm}^{-1})$  : 3400, 3180, 3060, 2800, 1650, 1580, 1512, 1421

<41>  $^1\text{H}$  NMR (DMSO- $\text{d}_6$ , 300MHz)(ppm) :

<42> 6.35 (2H, brs,  $-\text{NH}_2$ )

<43> 8.13 (1H, s, H of C-8)

<44> 8.65 (1H, s, H of C-6)

<45> [실시예 2] 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린의 제조

<46> 16.92g(50mmole)의 2-아미노푸린·탈륨염을 140ml의 N,N-디메틸포름아미드에 혼탁시키고, 반응기의 온도를 15℃ 이하로 유지시켰다. 30ml의 N,N-디메틸포름아미드에 용해시킨 16.03g(60mmole)의 2-아세톡시메틸-4-부로모부트-1-일-아세테이트를 이 반응 혼합액에 서서히 가한 후, 상온에서 84시간 동안 교반하였다. 반응 완결 후, 냉각하고 여과시킨 다음, 여액을 감압 농축하여 용매를 제거하였다. 실리카겔 크로마토그래피( $\text{CHCl}_3:\text{MeOH}=90:1$ )를 통한 정제에 의하여  $r_f=0.82$ 에서 9.80g(61%)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린을 얻었다.

<47> 융점 : 101~103℃

<48> IR :  $V_{\max}(\text{cm}^{-1})$  : 3330, 3163, 1746, 1729, 1654, 1612, 1582

<49>  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ , 300MHz)(ppm) :

<50> 1.99~1.95 (3H, m,  $=\text{NCH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{}$ )

<51> 2.00 (6H, s,  $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OCOCH}_3)_2$ )

<52> 4.03 (4H, d,  $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OCOCH}_3)_2$ )

<53> 4.14 (2H, t,  $=\text{NCH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{}$ )

<54> 6.45 (2H, brs,  $-\text{NH}_2$ )

<55> 8.09 (1H, s, H of C-8)

<56> 8.57 (1H, s, H of C-6)



<57> 또한  $r_f=0.49$ 에서 반응 부생성물인 0.19g(1.2%)의 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린을 얻었다.

<58> 융점 :  $137 \sim 139^{\circ}\text{C}$

<59> IR :  $V_{\max}(\text{cm}^{-1})$  : 3330, 3160, 1743, 1728, 1645, 1606

<60>  $^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ , 300MHz)(ppm) :

<61> 1.86~2.03 (9H, m,  $=\text{NCH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{}$  and  $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OCOCH}_3)_2$ )

<62> 4.07 (4H, d,  $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OCOCH}_3)_2$ )

<63> 4.16 (2H, t,  $=\text{NCH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{}$ )

<64> 6.38 (2H, brs,  $-\text{NH}_2$ )

<65> 8.06 (1H, s, H of C-8)

<66> 8.61 (1H, s, H of C-6)

<67> [실시예 3] 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린의 제조

<68> 16.92g(50mmole)의 2-아미노푸린·탈륨염을 140ml의 N,N-디메틸포름아미드에 혼탁시키고, 반응기의 온도를  $15^{\circ}\text{C}$  이하로 유지시켰다. 30ml의 N,N-디메틸포름아미드에 용해시킨 16.03g(60mmole)의 2-아세톡시메틸-4-부로모부트-1-일-아세테이트를 이 반응 혼합액에 서서히 가한 후 상온에서 84시간 동안 교반하였다. 반응 완결 후, 냉각하고 여과시킨 다음, 여액에 100ml의 물을 가하였다. 70ml의  $\text{CHCl}_3$ 로 3회 추출한 다음, 황산 마그네슘으로 건조하고 감압 농축하여 용매를 제거한 후, 잔사를 아세트산에틸, 헥산 및 tert-

부탄올의 혼합용매로 결정화하여 8.35g(52%)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린을 얻었다.

<69> 여기서 Spectrum data는 실시예 2와 동일하였다.

#### 【발명의 효과】

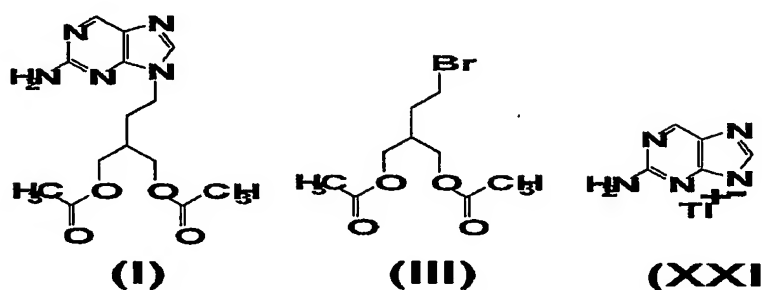
<70> 본 발명에 따른 제조방법에 의하면, 항바이러스 활성을 갖는 푸린유도체, 일명 팜시클로버(Famciclovir)인 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)을 이 반응의 핵심물질인 탈륨(I) 에톡사이드(Thallium(I) ethoxide)를 도입함으로써 반응 부생성물인 7-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(7-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)의 생성을 최소화하여 매우 높은 선택성(98%)으로 온화한 반응 조건 하에 제조할 수가 있다.

## 【특허청구범위】

## 【청구항 1】

하기 구조식(XXI)의 화합물과 하기 구조식(III)의 화합물을 극성 유기용매 하에서 반응시키는 것으로 구성되는 하기 구조식(I)의 화합물의 제조방법.

[ 구조식 I, III, XXI ]



## 【청구항 2】

제1항에 있어서, 상기한 극성 유기용매가 N,N-디메틸포름아미드, 디페닐설폭시드 및, 탄소수 1~3의 저급 알콜성 용매로 이루어지는 군으로부터 선택되는 적어도 1종의 용매인 제조방법.

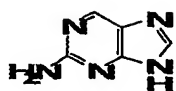
## 【청구항 3】

제1항 또는 제2항에 있어서, 상기한 반응이 0℃ 내지 100℃의 온도 범위에서 수행되는 제조방법.

## 【청구항 4】

제1항에 있어서, 상기 구조식(XXI)의 화합물이 하기 구조식(II)의 화합물을 구조식(IV)의 화합물과 반응시켜 얻어지는 제조방법.

[구조식 II, IV]



(II)

TIC

(IV)

## 【청구항 5】

제4항에 있어서, 상기한 반응이 N,N-디메틸포름아미드, 디페닐술폰시드 및, 탄소수 1~3의 저급 알콜성 용매로 이루어지는 균으로부터 선택되는 적어도 1종의 극성 유기용매 중에서 수행되는 제조방법.

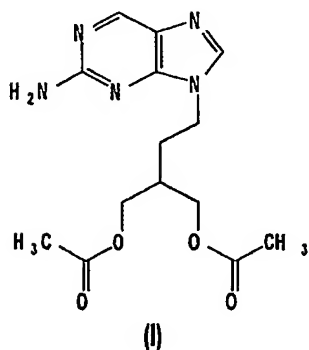
## 【청구항 6】

제4항 또는 제5항에 있어서, 상기한 반응이 0℃ 내지 100℃의 온도 범위에서 수행되는 제조방법.

## 【청구항 7】

탈륨(I) 에톡시드(Thallium(I) ethoxide: TIOEt)를 사용하는 것을 특징으로 하는 하기 구조식(I)의 9-[4-아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미노푸린(9-[4-Acetoxy-3-(acetoxymethyl)but-1-yl]-2-aminopurine)의 제조방법.

## [구조식 I]



(I)

## 【서지사항】

【서류명】	명세서 등 보정서
【수신처】	특허청장
【제출일자】	2002.11.22
【제출인】	
【명칭】	경동제약 주식회사
【출원인코드】	1-1998-000085-9
【사건과의 관계】	출원인
【대리인】	
【성명】	이주기
【대리인코드】	9-1998-000333-0
【포괄위임등록번호】	2002-043164-1
【대리인】	
【성명】	이순노
【대리인코드】	9-2002-000227-3
【포괄위임등록번호】	2002-043165-8
【사건의 표시】	
【출원번호】	10-2002-0041267
【출원일자】	2002.07.15
【발명의 명칭】	9-[4- 아세톡시-3-(아세톡시메틸)부트-1-일]-2-아미 노푸린의제 조방법
【제출원인】	
【접수번호】	1-1-02-0224926-12
【접수일자】	2002.07.15
【보정할 서류】	명세서등
【보정할 사항】	
【보정대상항목】	별지와 같음
【보정방법】	별지와 같음
【보정내용】	별지와 같음
【취지】	특허법시행규칙 제13조·실용신안법시행규칙 제8조 의 규정에의하여 위와 같 이 제출합니다. 대리인 이주기 (인) 대리인 이순노 (인)

020041267

출력 일자: 2003/7/30

【수수료】

【보정료】 0 원

【추가심사청구료】 0 원

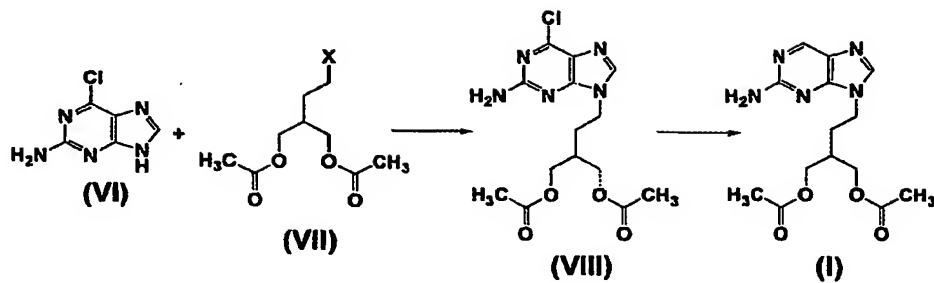
【기타 수수료】 0 원

【합계】 0 원

【보정대상항목】 식별번호 10

【보정방법】 정정

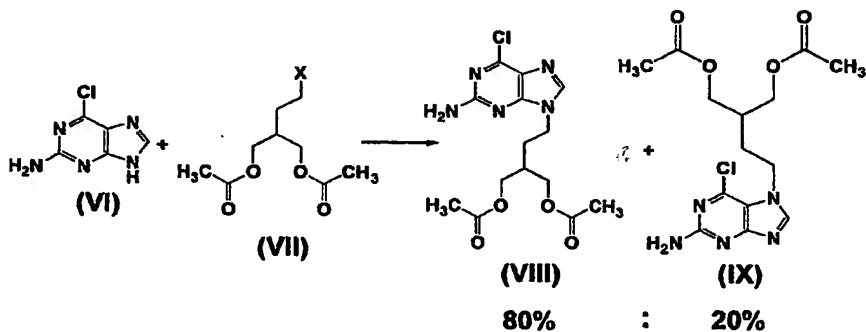
【보정내용】



【보정대상항목】 식별번호 14

【보정방법】 정정

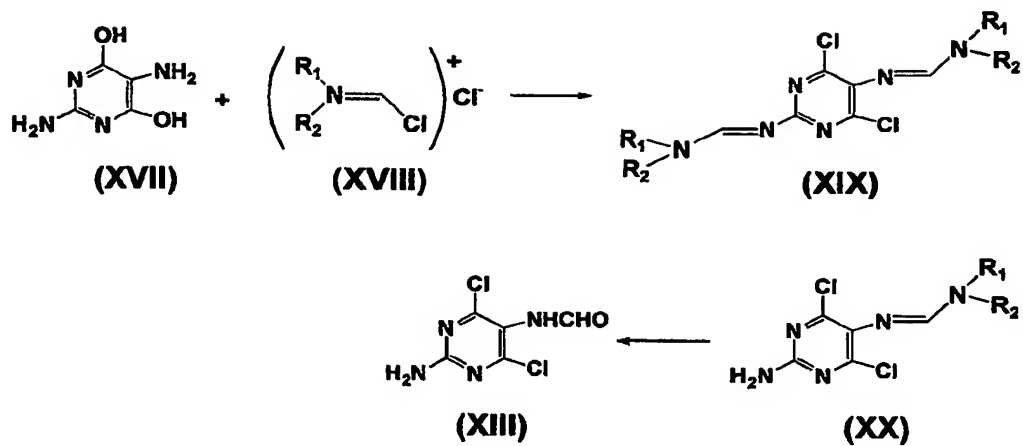
【보정내용】



【보정대상항목】 식별번호 27

【보정방법】 정정

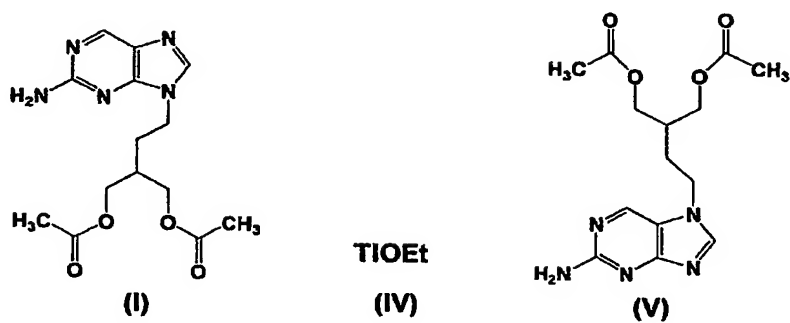
【보정내용】



【보정대상항목】 식별번호 30

【보정방법】 정정

【보정내용】





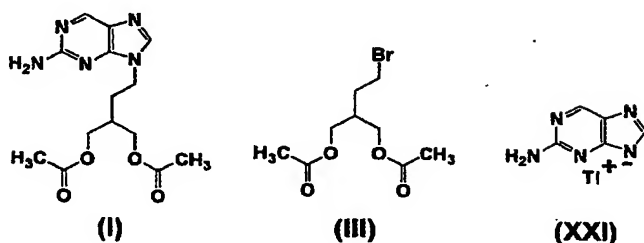
【보정대상항목】 청구항 1

【보정방법】 정정

【보정내용】

하기 구조식(XXI)의 화합물과 하기 구조식(III)의 화합물을 극성 유기용매 하에서 반응시키는 것으로 구성되는 하기 구조식(I)의 화합물의 제조방법.

[ 구조식 I, III, XXI]



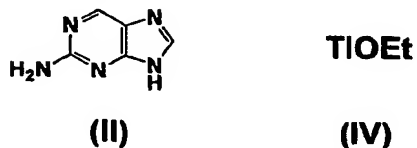
【보정대상항목】 청구항 4

【보정방법】 정정

【보정내용】

제1항에 있어서, 상기 구조식(XXI)의 화합물이 하기 구조식(II)의 화합물을 구조식(IV)의 화합물과 반응시켜 얻어지는 제조방법.

[ 구조식 II, IV]



**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☒ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**